

DOCKET NO.: 220304US0XPCT

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

IN RE APPLICATION OF: Atsushi YASUDA et al.

SERIAL NO.: NEW U.S. PCT APPLICATION

FILED: HERewith

INTERNATIONAL APPLICATION NO.: PCT/JP00/06165

INTERNATIONAL FILING DATE: September 8, 2000

FOR: PYRIMIDINE DERIVATIVES AND HERBICIDES CONTAINING THEM

**REQUEST FOR PRIORITY UNDER 35 U.S.C. 119
AND THE INTERNATIONAL CONVENTION**

Assistant Commissioner for Patents
Washington, D.C. 20231

Sir:

In the matter of the above-identified application for patent, notice is hereby given that the applicant claims as priority:

<u>COUNTRY</u>	<u>APPLICATION NO</u>	<u>DAY/MONTH/YEAR</u>
Japan	11-255029	09 September 1999

Certified copies of the corresponding Convention application(s) were submitted to the International Bureau in PCT Application No. PCT/JP00/06165. Receipt of the certified copy(s) by the International Bureau in a timely manner under PCT Rule 17.1(a) has been acknowledged as evidenced by the attached PCT/IB/304.

Respectfully submitted,
OBLON, SPIVAK, McCLELLAND,
MAIER & NEUSTADT, P.C.

William E. Beaumont

Registration Number 30,796

Norman F. Oblon
Attorney of Record
Registration No. 24,618
Surinder Sachar
Registration No. 34,423



22850

(703) 413-3000
Fax No. (703) 413-2220
(OSMMN 1/97)

10070804-031103

THIS PAGE BLANK (USPTO)

JP00/645

4

日本国特許庁

PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

#2
T/JP00/06165

04.10.00

REC'D 28 NOV 2000

WIPO PCT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日

Date of Application:

1999年 9月 9日

出願番号

Application Number:

平成11年特許願第255029号

出願人

Applicant(s):

クミアイ化学工業株式会社
イハラケミカル工業株式会社

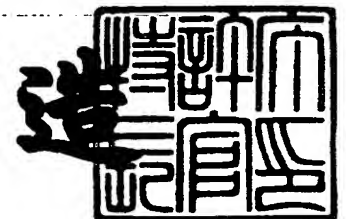
PRIORITY
DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2000年11月10日

特許庁長官
Commissioner,
Patent Office

及川耕造



出証番号 出証特2000-3092481

【書類名】 特許願

【整理番号】 IC1115

【提出日】 平成11年 9月 9日

【あて先】 特許庁長官 殿

【国際特許分類】 C07D239/02
A01N 43/54

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社ケ
イ・アイ研究所内

【氏名】 安田 厚司

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社ケ
イ・アイ研究所内

【氏名】 高部 文明

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社ケ
イ・アイ研究所内

【氏名】 漆畑 育巳

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社ケ
イ・アイ研究所内

【氏名】 山口 幹夫

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地

【氏名】 山地 充洋

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地

【氏名】 藤波 周

【発明者】

【住所又は居所】 静岡県小笠郡大東町岩滑 1 2 0 5 - 9

【氏名】 宮沢 武重

【特許出願人】

【識別番号】 000000169

【氏名又は名称】 クミアイ化学工業株式会社

【代表者】 望月 信彦

【特許出願人】

【識別番号】 000102049

【氏名又は名称】 イハラケミカル工業株式会社

【代表者】 望月 信彦

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 033547

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【プルーフの要否】 要

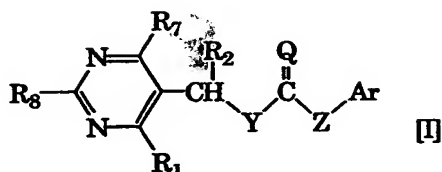
【書類名】 明細書

【発明の名称】 ピリミジン誘導体及びそれを含有する農薬、特に除草剤

【特許請求の範囲】

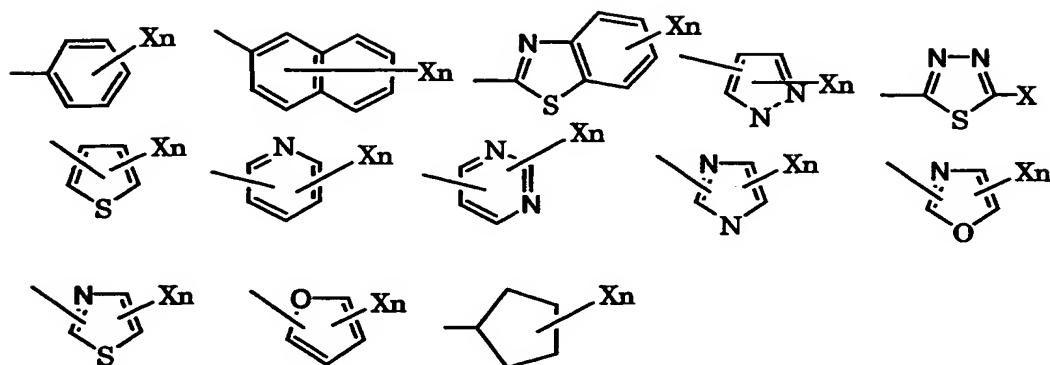
【請求項1】 一般式【I】

【化1】



{式中、 R_1 は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、シクロアルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基又はアルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基を表し、 R_2 は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキルチオ基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコシアルキル基、アルキルチオアルキル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基により置換されてもよい。）又はチエニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基により置換されてもよい。）を表し、 Y は NR_3 を表し、 R_3 は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、ジアルキルアミノ基、シクロアルキル基又はアルコシアルキル基を表し、 Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、 Z は酸素原子、硫黄原子、 NR_6 基、 C_2H_4 基、基- $CH=CH$ -、基- $C(R_4)R_5$ -、基- $C(R_4)R_5-Q$ -、基- $Q-C(R_4)R_5$ -、基- $C(=Q)-$ を表し、 R_4 及び R_5 は水素原子、アルキル基、ハロゲン原子、アルコキシ基及びアルキルチオ基を表し、 R_6 は水素原子及びアルキル基を表し、 Ar 基は一般式、

【化2】



(式中、Xは水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、アルコキシアルキル基、モノアルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又はハロアルキル基を表し、nは1～3の整数を表し、nが2～3の整数の場合は、Xは、同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が2個結合して低級アルキレンジオキシ基を形成してもよい。)で示される基を表し、R₇は水素原子、アルキル基、ハロアルキル基又はシクロアルキル基を表し、R₈は水素原子、アルキル基、アルキルチオ基、ハロアルキル基又はシクロアルキル基を表す。)で示されるピリミジン誘導体。

【請求項2】 請求項1に記載のピリミジン誘導体を有効成分として含有する農薬、特に除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】

本発明は、新規な置換ピリミジン誘導体及びこれを有効成分として含有する農薬（除草剤、殺菌剤）、特に除草剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術】

置換ピリミジン誘導体については、国際出願W095/12582号公報明細書、国際出願W096/22980号公報明細書、国際出願W097/12877号公報明細書等に知られている

が、本発明のピリミジン誘導体は未だ知られていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】

有用作物に対して使用される除草剤は、畑作土壌又は水田に施用し、低薬量で十分な除草効果を示し、しかも作物と雑草間の選択性を発揮する薬剤であることが望まれる。そこで本発明は優れた除草活性ならびに作物雑草間に選択性のある化合物を提供することを課題とする。

【0004】

【課題を解決するための手段】

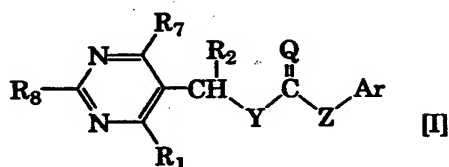
本発明者らは、このような状況に鑑み種々の置換ピリミジン誘導体を合成し、その生理活性について検討を重ねた。その結果、本発明化合物の新規な置換ピリミジン誘導体が優れた除草活性ならびに作物雑草間に選択性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

【0005】

即ち、本発明は、一般式【I】

【0006】

【化3】



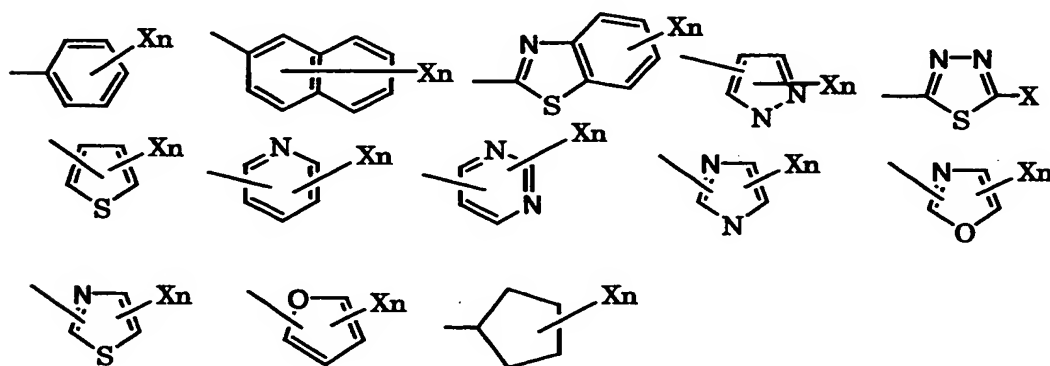
【0007】

{式中、 R_1 は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、シクロアルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基を表し、 R_2 は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキルチオ基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコキシアルキル基、アルキルチオアルキル基、シク

ロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基により置換されてもよい。）又はチエニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基又はアルキルスルホニル基により置換されてもよい。）を表し、YはNR₃を表し、R₃は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、ジアルキルアミノ基、シクロアルキル基又はアルコキシアルキル基を表し、Qは酸素原子又は硫黄原子を表し、Zは酸素原子、硫黄原子、NR₆、基-C₂H₄-、基-CH=CH-、基-C(R₄)R₅-、基-C(R₄)R₅-Q-、基-Q-C(R₄)R₅-、基-C(=Q)-を表し、R₄及びR₅は水素原子、アルキル基、ハロゲン原子、アルコキシ基及びアルキルチオ基を表し、R₆は水素原子及びアルキル基を表し、Ar基は一般式、

【0008】

【化4】



【0009】

（式中、Xは水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、アルコキシアルキル基、モノアルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又はハロアルキル基を表し、nは1～3の整数を表し、nが2～3の整数の場合は、Xは、同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が2個結合して低級アルキレンジオキシ基を形成して

もよい。)で示される基を表し、 R_7 は水素原子、アルキル基、ハロアルキル基又はシクロアルキル基を表し、 R_8 は水素原子、アルキル基、アルキルチオ基、ハロアルキル基又はシクロアルキル基を表す。}で示されるピリミジン誘導体及び、これを有効成分として含有する農薬、特に除草剤を提供するものである。

【0010】

尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

【0011】

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を示す。

【0012】

アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1~6の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を意味し、例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基等を挙げることができる。

【0013】

シクロアルキル基とは、炭素数が3~6のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等を挙げることができる。

【0014】

アルケニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えばエテニル基、2-プロペニル基等を挙げることができる。

【0015】

アルキニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えばエチニル基、2-プロピニル基等を挙げることができる。

【0016】

ハロアルキル基とは、特に限定しない限り、同一又は相異なるハロゲン原子1~9で置換されている炭素数が1~4の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を示し、例えばクロロメチル基、トリフルオロメチル基、テトラフルオロエチル基等を挙げることができる。

【0017】

アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-O-基を

示し、例えばメトキシ基、エトキシ基等を挙げることができる。

【0018】

アルコキシアルキル基とは、アルキル部分が上記の意味である（アルキル）-O-（アルキル）-基を示し、例えばメトキシメチル基、エトキシメチル基等を挙げることができる。

【0019】

ハロアルコキシ基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である（ハロアルキル）-O-基を示し、例えばトリフルオロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基等を挙げることができる。

【0020】

アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基及びアルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である（アルキル）-S-基、（アルキル）-SO-基、（アルキル）-SO₂-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0021】

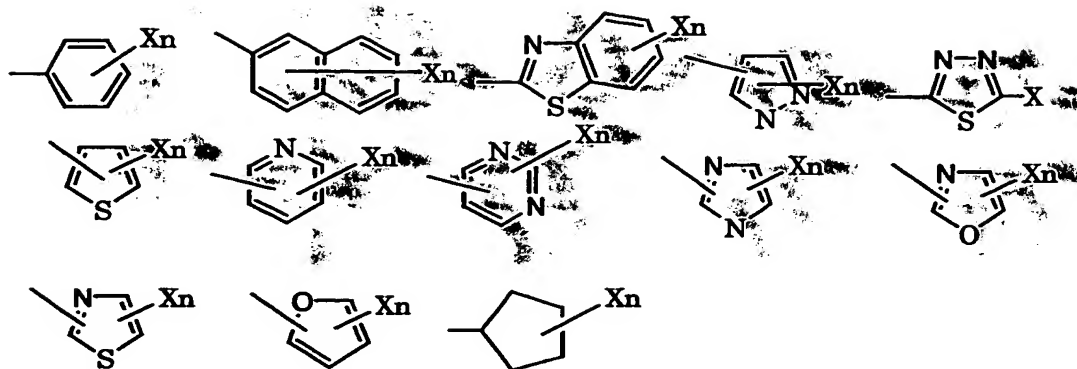
モノアルキルアミノ基及びジアルキルアミノ基とは、アルキル部分が上記の意味である（アルキル）-NH-基、（アルキル）₂N-基を示し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等を挙げることができる。

【0022】

前記一般式 [I] において、好ましい化合物群としては、R₁が水素原子、アルキル基、シクロアルキル基、ハロアルキル基又はアルキルチオ基であり、R₂がアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子又はハロアルキル基により置換されてもよい。）又はチエニル基（該基はハロゲン原子又はアルキル基により置換されてもよい。）であり、YがNR₃であり、R₃がアルキル基であり、Qが酸素原子又は硫黄原子であり、Zが酸素原子、硫黄原子、NR₆、基-C(R₄)R₅-又は基-C(R₄)R₅-Q-であり、R₄及びR₅が水素原子又はアルキル基であり、R₆が水素原子又はアルキル基であり、Ar基が一般式、

【0023】

【化5】



【0024】

(式中、Xは水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルコキシアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基又はハロアルキル基を表し、nは1~3の整数を表す。)であり、 R_7 が水素原子、アルキル基、ハロアルキル基又はシクロアルキル基であり、 R_8 が水素原子、アルキル基、アルキルチオ基、ハロアルキル基又はシクロアルキル基で表される化合物群が挙げられる。

【0025】

【発明の実施の形態】

次に、一般式 [I] で表される本発明化合物の代表的な具体例を表1~表19に例示する。しかしながら、本発明化合物はこれらの化合物に限定されるものではない。尚、化合物番号は以後の記載において参照される。

【0026】

本明細書における表中の次の表記は下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

【0027】

Me	: メチル基	Et	: エチル基
Pr	: n-プロピル基	Pr-i	: イソプロピル基
Pr-c	: シクロプロピル基	Bu	: n-ブチル基
Bu-i	: イソブチル基	Bu-s	: sec-ブチル基
Bu-t	: tert-ブチル基	Bu-c	: シクロブチル基
Pen	: n-ペンチル基	Pen-i	: イソペンチル基

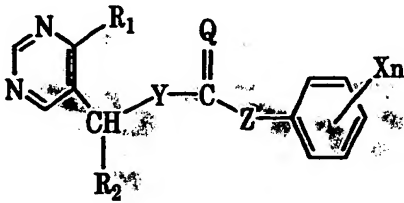
特平 1 1 - 2 5 5 0 2 9

Pen-c : シクロペンチル基、

Hex-c : シクロヘキシル基、

【 0 0 2 8 】

【表1】

							
化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-1	CClF ₂	Pr-c	NH	CH ₂	H	O	124-127
1-2	CClF ₂	Pr-c	NH	CH ₂	4-OMe	O	116-119
1-3	CClF ₂	Pr-c	NH	CH ₂	4-Cl	O	125-128
1-4	CClF ₂	Pr-c	NH	CH ₂	4-CF ₃	O	111-114
1-5	CF ₃	Pr-i	NH	CH ₂	H	O	144-146
1-6	CF ₃	Pr-i	NH	CH ₂	4-OMe	O	114-117
1-7	CF ₃	Pr-i	NH	CH(Me)	H	O	1.5163
1-8	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	106-109
1-9	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-OMe	O	1.5289
1-10	CF ₃	Pr-i	N(Me)	S	H	O	131-133
1-11	CF ₃	Pr-i	N(Me)	S	4-OMe	O	156-159
1-12	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	109-110
1-13	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-OEt	O	1.5151
1-14	CF ₃	Pr-i	N(Me)	S	4-Cl	O	
1-15	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	109-112
1-16	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-OMe	O	測定不可
1-17	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	S	H	O	127-130
1-18	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	S	4-OMe	O	136-139
1-19	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	O	H	O	115-118
1-20	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Cl	O	178-181
1-21	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Cl	O	122-125
1-22	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	98-101
1-23	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	76-79
1-24	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	105-108

【0029】

【表2】

化合物 番 号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-25	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	126-129
1-26	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	H	O	87-90
1-27	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-F	O	130-132
1-28	CF ₃	Pr-i	N(Me)	NH	H	O	149-150
1-29	CF ₃	Pr-i	N(Me)	NH	4-Cl	O	
1-30	CF ₃	Me	N(Me)	CH ₂	H	O	1.5258
1-31	CF ₃	Me	N(Me)	CH ₂	4-F	O	1.5202
1-32	CF ₃	Et	N(Me)	CH ₂	H	O	40-41
1-33	CF ₃	Et	N(Me)	CH ₂	4-F	O	72-73
1-34	CF ₃	Pr-c	N(Me)	CH ₂	H	O	測定不可
1-35	CF ₃	Pr-c	N(Me)	CH ₂	4-F	O	97-99
1-36	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-F	O	93-94
1-37	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	NH	4-Me	O	135-137
1-38	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	NH	H	O	146-147
1-39	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	119-120
1-40	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,5-F ₂	O	145-146
1-41	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	93-95
1-42	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-I	O	102-104
1-43	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Bu-t	O	101-102
1-44	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-SMe	O	69-71
1-45	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-Cl ₂	O	145-146
1-46	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	115-116
1-47	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-OMe,4-Cl	O	129-131
1-48	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	120-123
1-49	CF ₃	Pr-i	N(Pr)	CH ₂	4-Cl	O	140-141
1-50	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Me	O	154-155
1-51	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Me	O	93-94
1-52	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-NO ₂	O	146-149
1-53	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-F	O	91-92
1-54	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	111-112

【0030】

【表3】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Xn	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-55	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	84-87
1-56	CH ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	118-119
1-57	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	H	O	70-71
1-58	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	4-F	O	84-85
1-59	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	73-75
1-60	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	61-64
1-61	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	92-94
1-62	CF ₃	Pr-i	N(Pr)	CH ₂	4-Me	O	83-86
1-63	CF ₃	Pr-i	N(Pr)	CH ₂	H	O	146-147
1-64	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	H	O	117-119
1-65	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	4-Cl	O	141-142
1-66	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F	O	120-123
1-67	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Et	O	56-58
1-68	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Pr-i	O	86-87
1-69	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂ S	H	O	
1-70	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Br	O	120-121
1-71	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	1.5232
1-72	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	83-85
1-73	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂ S	4-Cl	O	
1-74	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-NO ₂	O	118-121
1-75	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CN	O	141-142
1-76	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CH ₂ OMe	O	58-60
1-77	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ CH ₂	H	O	79-82
1-78	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	110-113
1-79	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	69-70
1-80	CF ₃	Pr-i	N(Pr-c)	CH ₂	H	O	83-86
1-81	CF ₃	Pr-i	N(Pr-c)	CH ₂	4-Cl	O	1.5297
1-82	CF ₃	Pr-i	N(Pr-c)	CH ₂	4-Me	O	1.5219
1-83	CF ₃	Pr-i	N(Pr-c)	CH ₂	4-F	O	81-84
1-84	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-C≡CMe	O	128-132

【0031】

【表4】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-85	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH=CH	H	O	1.5375
1-86	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH=CH	4-Cl	O	1.5565
1-87	CH ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	80-83
1-88	CH ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	102-104
1-89	CH ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	106-107
1-90	H	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	1.5503
1-91	CClF ₂	Pr-c	N(Me)	CH ₂	H	O	111-113
1-92	CClF ₂	Pr-c	N(Me)	CH ₂	4-F	O	91-92
1-93	CClF ₂	Pr-c	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	87-88
1-94	CClF ₂	Pr-c	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	112-114
1-95	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-OCF ₃	O	80-81
1-96	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-OCHF ₂	O	54-57
1-97	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-OPr-i	O	74-75
1-98	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-CN	O	139-142
1-99	CF ₃	Pr-i	N(Pr)	CH ₂	4-CN	O	162-163
1-100	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-F	O	163-164
1-101	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	111-112
1-102	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	81-83
1-103	CF ₃	Pr-i	N(Pr-i)	CH ₂	H	O	1.5131
1-104	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-SO ₂ Me	O	137-139
1-105	CF ₃	Pr-i	N(CH ₂ OMe)	CH ₂	4-Cl	O	142-145
1-106	CF ₃	Pr-i	N(CH ₂ OMe)	CH ₂	4-Me	O	104-106
1-107	CF ₃	Pr-i	N(CH ₂ OEt)	CH ₂	4-Me	O	91-94
1-108	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	4-F	O	
1-109	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	4-Me	O	
1-110	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	4-Cl	O	
1-111	CF ₃	Pr	N(Me)	CH ₂	H	O	54-55
1-112	CF ₃	Pr	N(Me)	CH ₂	4-F	O	67-70
1-113	CF ₃	Pr	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	63-64
1-114	CF ₃	Pr	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	91-92

【0032】

【表5】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Xn	Q	融点(°C) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-115	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)O	H	O	127-130
1-116	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)O	4-Cl	O	104-105
1-117	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)O	4-Me	O	
1-118	CF ₃	Pr-i	N(Me)	OCH ₂	H	O	1.5028
1-119	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-OMe,4-Me	O	1.5109
1-120	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Me,4-Cl	O	92-94
1-121	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Cl,4-Me	O	121-122
1-122	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	135-136
1-123	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,6-F ₂	O	176-177
1-124	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,4-Cl ₂	O	147-149
1-125	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	2-F	O	157-158
1-126	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	3-F	O	127-128
1-127	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	4-F	O	119-121
1-128	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	118-119
1-129	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	125-126
1-130	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	123-126
1-131	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	110-113
1-132	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	2-Cl	O	162-163
1-133	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	3-Cl	O	122-124
1-134	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	2-Me	O	136-138
1-135	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	3-Me	O	117-119
1-136	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	4-Me	O	140-141
1-137	CF ₃	Pen-c	N(Me)	CH ₂	H	O	72-74
1-138	CF ₃	Pen-c	N(Me)	CH ₂	4-F	O	97-99
1-139	CF ₃	Pen-c	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	55-57
1-140	CF ₃	Pen-c	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	69-71
1-141	CF ₃	Pen-c	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	76-78
1-142	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	S	93-94
1-143	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	S	103-104
1-144	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	S	92-93

【0033】

【表6】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-145	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	S	1.5541
1-146	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-(-OCH ₂ O-)	O	82-85
1-147	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	137-139
1-148	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,3-F ₂	O	183-184
1-149	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,3,4-F ₃	O	
1-150	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	88-89
1-151	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	125-127
1-152	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	121-124
1-153	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	78-79
1-154	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(SMe)	4-Cl	O	148-149
1-155	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(OMe)	4-Cl	O	107-108
1-156	CF ₃	Pen-c	N(Me)	CH ₂	2-F	O	111-112
1-157	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-N(Me) ₂	O	109-111
1-158	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH ₂	3-F	O	85-86
1-159	CH ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	H	O	93-95
1-160	CH ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-F	O	96-98
1-161	CH ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	107-109
1-162	CH ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	84-85
1-163	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	62-65
1-164	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	82-84
1-165	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	85-87
1-166	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	83-84
1-167	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	156-157
1-168	CHF ₂	Pr-i	N(Et)	CH ₂	H	O	85-86
1-169	CHF ₂	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-F	O	100-103
1-170	CHF ₂	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	114-117
1-171	CHF ₂	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	91-92
1-172	CF ₃	Pr-i	N(CH ₂ C≡CH)	CH ₂	4-F	O	124-128
1-173	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	3-F	O	119-121
1-174	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	4-CF ₃	O	100-101

【 0 0 3 4 】

【表7】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Xn	Q	融点(°C) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-175	CF ₃	Pr-i	N(Me)	C(Me) ₂	4-Me	O	108-110
1-176	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	H	O	80-81
1-177	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	4-F	O	110-112
1-178	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	4-Cl	O	112-115
1-179	CF ₃	Pr-i	N(Me)	O	4-Me	O	94-97
1-180	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	120-124
1-181	CF ₃	Pr-i	N(Pr)	CH ₂	4-F	O	126-127
1-182	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ S	H	O	105-108
1-183	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ S	4-Cl	O	111-113
1-184	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	O	4-F	O	119-123
1-185	CClF ₂	Pr-i	N(Me)	O	4-Cl	O	99-103
1-186	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	H	O	86-87
1-187	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	146-147
1-188	Bu-t	Me	N(Me)	CH ₂	H	O	1.5511
1-189	Bu-t	Me	N(Me)	CH ₂	4-F	O	88-89
1-190	Bu-t	Me	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	1.5532
1-191	Bu-t	Me	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	1.5471
1-192	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-OMe	O	1.5135
1-193	CF ₃	Pr-i	N(CH ₂ C≡CH)	CH ₂	H	O	117-121
1-194	CF ₃	Pr-i	N(CH ₂ C≡CH)	CH ₂	4-Cl	O	119-121
1-195	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	H	O	測定不可
1-196	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	H	O	107-109
1-197	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	151-154
1-198	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	1.4992
1-199	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-200	CF ₃	2-thienyl	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	120-121
1-201	SMe	Bu-t	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-202	SMe	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-203	SMe	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-204	SMe	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	

【0035】

【表8】

化合物 番 号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-205	SMe	Ph	N(Me)	CH ₂	H	O	90-91
1-206	SMe	Ph	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-207	SMe	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-208	SMe	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-209	Pr-i	Bu-t	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-210	Pr-i	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-211	Pr-i	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-212	Pr-i	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-213	Pr-i	Ph	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-214	Pr-i	Ph	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-215	Pr-i	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-216	Pr-i	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-217	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH ₂	H	O	111-112
1-218	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH ₂	4-F	O	99-101
1-219	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	137-139
1-220	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	132-134
1-221	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH ₂	H	O	136-137
1-222	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH ₂	4-F	O	114-115
1-223	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	99-103
1-224	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-225	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-226	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-227	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-228	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-229	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-230	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-231	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-232	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-233	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-234	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH ₂	4-F	O	

【 0 0 3 6 】

【表9】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Xn	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-235	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-236	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-237	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH ₂	H	O	
1-238	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH ₂	4-F	O	
1-239	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	
1-240	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	
1-241	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-242	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-243	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-244	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-245	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-246	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-247	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-248	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Br	O	
1-249	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	101-103
1-250	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	170-173
1-251	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	84-85
1-252	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	
1-253	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	
1-254	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	141-142
1-255	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	
1-256	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	
1-257	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-258	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-259	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-260	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-261	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-262	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-263	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	
1-264	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3,4-(Me) ₂	O	

【0037】

【表10】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-265	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-F	O	103-104
1-266	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3-F	O	88-90
1-267	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3-F	O	85-87
1-268	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F	O	
1-269	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F	O	
1-270	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F	O	151-153
1-271	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F	O	
1-272	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-F	O	
1-273	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	137-140
1-274	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	107-110
1-275	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	
1-276	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	
1-277	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	
1-278	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	
1-279	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	
1-280	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	2,4-F ₂	O	
1-281	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-282	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-283	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-284	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-285	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-286	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-287	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-288	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-F,4-Cl	O	
1-289	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-290	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-291	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-292	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-293	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-294	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	

【0038】

【表11】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-295	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-296	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3,4-F ₂	O	
1-297	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-298	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-299	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-300	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-301	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-302	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-303	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-304	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3,5-F ₂	O	
1-305	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	85-87
1-306	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	92-93
1-307	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	123-125
1-308	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	
1-309	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	
1-310	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	139-140
1-311	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	
1-312	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃	O	
1-313	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-314	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-315	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-316	CHF ₂	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-317	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-318	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-319	Pr-c	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-320	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-CF ₃	O	
1-321	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	2-F,4-Cl	O	144-146
1-322	Ph	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	O	82-84
1-323	Ph	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	104-105
1-324	Ph	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	O	88-90

【0039】

【表12】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-325	Ph	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	O	79-80
1-326	Pr-i	Pr-i	N(Me)	NH	H	O	199-200
1-327	Pr-i	Pr-i	N(Me)	N(Me)	H	O	1.5384
1-328	CF ₃	Pr-i	N(Me)	C(=O)	H	O	101-102
1-329	CF ₃	Pr-i	N(Me)	C(Me) ₂	4-Cl	O	測定不可
1-330	CF ₃	Bu-i	N(Me)	CH ₂	H	O	86-87
1-331	CF ₃	Bu-i	N(Me)	CH ₂	4-F	O	97-98
1-332	CF ₃	Pr-i	N(OMe)	CH ₂	H	O	1.5071
1-333	CF ₃	Pr-i	N(OMe)	CH ₂	4-F	O	59-62
1-334	CF ₃	Bu-i	N(Me)	CH ₂	3-F	O	93-94
1-335	CF ₃	Pr-i	N(Me)	C(=O)	4-Cl	O	116-119
1-336	Pr-i	Ph	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-337	CF ₃	Ph(4-F)	N(Et)	CH ₂	H	O	
1-338	CF ₃	Ph(4-F)	N(Et)	CH ₂	4-F	O	
1-339	CF ₃	Ph(4-F)	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	
1-340	CF ₃	Ph(4-F)	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-341	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Et)	CH ₂	H	O	
1-342	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Et)	CH ₂	4-F	O	
1-343	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	
1-344	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-345	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Et)	CH ₂	H	O	
1-346	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Et)	CH ₂	4-F	O	
1-347	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	
1-348	CF ₃	Ph(4-Me)	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-349	CF ₃	3-Thienyl	N(Et)	CH ₂	H	O	
1-350	CF ₃	3-Thienyl	N(Et)	CH ₂	4-F	O	
1-351	CF ₃	3-Thienyl	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	
1-352	CF ₃	3-Thienyl	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-353	CF ₃	2-Thienyl	N(Et)	CH ₂	H	O	
1-354	CF ₃	2-Thienyl	N(Et)	CH ₂	4-F	O	

【 0 0 4 0 】

【表13】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-355	CF ₃	2-Thienyl	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	
1-356	CF ₃	2-Thienyl	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-357	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Et)	CH ₂	H	O	
1-358	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Et)	CH ₂	4-F	O	
1-359	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Et)	CH ₂	4-Cl	O	
1-360	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Et)	CH ₂	4-Me	O	
1-361	CF ₃	Ph	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-362	CF ₃	Ph	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-363	CF ₃	Ph	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-364	CF ₃	Ph	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-365	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-366	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-367	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-368	CF ₃	Ph(4-F)	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-369	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-370	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-371	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-372	CF ₃	Ph(4-Cl)	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-373	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-374	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-375	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-376	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-377	SMe	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-378	SMe	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-379	SMe	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-380	SMe	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-381	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-382	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-383	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-384	CF ₃	3-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-385	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH(Me)	H	O	

【0041】

【表14】

化合物 番 号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
1-386	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-387	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-388	CF ₃	Ph(3-Cl)	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-389	Me	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-390	Me	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-391	Me	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-392	Me	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-393	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-394	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-395	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-396	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	
1-397	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	H	O	
1-398	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	4-F	O	
1-399	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	4-Cl	O	
1-400	CF ₃	2-Thienyl	N(Me)	CH(Me)	4-Me	O	

【 0 0 4 2 】

【表15】

$ \begin{array}{c} \text{N} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{C} \quad \text{C} \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{N} \quad \text{R}_1 \quad \text{CH} \\ \quad \quad \quad \\ \quad \quad \quad \text{R}_2 \end{array} \begin{array}{c} \text{Y} \\ \\ \text{C} \\ \\ \text{Q} \end{array} \begin{array}{c} \text{Z} \\ \\ \text{Ar} \end{array} $						
化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Ar	Q 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
2-1	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Naphtyl	O 137-138
2-2	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O 37-38
2-3	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Pyridyl	O 99-100
2-4	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Pyridyl	O 93-96
2-5	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Pyridyl	O 115-118
2-6	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O 51-54
2-7	CHF ₂	Pr-i	N(Et)	CH ₂	2-Thienyl	O 69-71
2-8	CHF ₂	Pr-i	N(Et)	CH ₂	3-Thienyl	O 83-85
2-9	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	2-Thienyl	O 1.5197
2-10	CF ₃	Pr-i	N(Et)	CH ₂	3-Thienyl	O 1.5208
2-11	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O 1.5215
2-12	CF ₃	Bu-s	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O 1.5229
2-13	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O 1.5121
2-14	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O 58-62
2-15	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	2-Thienyl	O
2-16	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH(Me)	3-Thienyl	O
2-17	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	2-Thienyl	O
2-18	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH(Me)	3-Thienyl	O
2-19	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O 139-142
2-20	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O 142-145
2-21	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O

【0043】

【表16】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Ar	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
2-22	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O	79-81 101-103 94-95
2-23	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O	
2-24	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O	
2-25	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl-2-Thienyl	O	
2-26	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me-2-Thienyl	O	
2-27	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl-2-Thienyl	O	
2-28	SMe	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me-2-Thienyl	O	
2-29	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl-2-Thienyl	O	
2-30	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me-2-Thienyl	O	
2-31	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Cl-2-Thienyl	O	79-81
2-32	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Me-2-Thienyl	O	
2-33	CF ₃	Ph	N(Me)	CH(Me)	2-Thienyl	O	
2-34	CF ₃	Ph	N(Me)	CH(Me)	3-Thienyl	O	
2-35	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-CF ₃ -2-Thienyl	O	
2-36	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F-2-Thienyl	O	
2-37	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-Cl-2-Thienyl	O	
2-38	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	3-F-2-Thienyl	O	
2-39	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	5-Cl-3-Thienyl	O	
2-40	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	5-Me-3-Thienyl	O	160-161 106-107 145-147 120-122 138-141 108-112
2-41	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Br-1-Pyrazolyl	O	
2-42	CF ₃	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Cl-2-Thienyl	O	
2-43	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	5-Cl-2-Pyridyl	O	
2-44	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	5-Cl-3-Pyridyl	O	
2-45	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyridyl	O	
2-46	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	1-Me-3-CF ₃ - 5-Pyrazolyl	O	

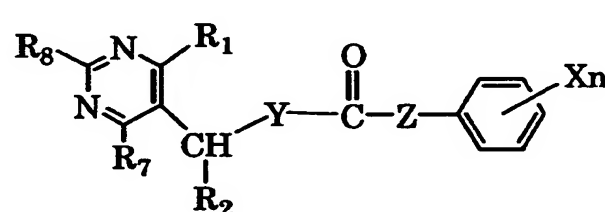
【0044】

【表17】

化合物 番 号	R ₁	R ₂	Y	Z	Ar	Q	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
2-47	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	5-CF ₃ -1,3,4- Thiaziazol-2-yl	O	121-122
2-48	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	2-Benzothiazolyl	O	192-195
2-49	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂ O	4-CF ₃ -2-Pyridyl	O	164-167
2-50	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	5-Me-2-Thienyl	O	73-75
2-51	CF ₃	Bu-i	N(Me)	CH ₂	2-Thienyl	O	68-70
2-52	CF ₃	Bu-i	N(Me)	CH ₂	3-Thienyl	O	81-82

【 0 0 4 5 】

【表18】

								
化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	X _n	R ₇	R ₈	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
3-1	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	H	Me	99-101
3-2	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	H	Me	74-75
3-3	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	H	Me	67-68
3-4	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	H	Me	85-86
3-5	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	H	Pr-c	144-145
3-6	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	H	Pr-c	131-132
3-7	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	H	Pr-c	99-100
3-8	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	H	Pr-c	82-83
3-9	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	Me	H	
3-10	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	Me	H	
3-11	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	Me	H	
3-12	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	Me	H	
3-13	Me	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	Me	H	
3-14	Me	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	Me	H	
3-15	Me	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	Me	H	
3-16	Me	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	Me	H	
3-17	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	Me	H	
3-18	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	Me	H	
3-19	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	Me	H	
3-20	Pr-i	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	Me	H	

【 0 0 4 6 】

【表19】

化合物 番号	R ₁	R ₂	Y	Z	Xn	R ₇	R ₈	融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰)
3-21	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	H	Me	H	
3-22	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-F	Me	H	
3-23	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Cl	Me	H	
3-24	Me	Bu-t	N(Me)	CH ₂	4-Me	Me	H	
3-25	Et	Et	N(Me)	CH ₂	H	Et	H	
3-26	Et	Et	N(Me)	CH ₂	4-F	Et	H	
3-27	Et	Et	N(Me)	CH ₂	4-Cl	Et	H	
3-28	Et	Et	N(Me)	CH ₂	4-Me	Et	H	
3-29	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	H	SMe	
3-30	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	H	SMe	
3-31	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	H	SMe	
3-32	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	H	SMe	
3-33	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	H	Me	H	
3-34	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-F	Me	H	
3-35	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Cl	Me	H	
3-36	CF ₃	Ph	N(Me)	CH ₂	4-Me	Me	H	
3-37	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	H	CF ₃	H	
3-38	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-F	CF ₃	H	
3-39	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Cl	CF ₃	H	
3-40	CF ₃	Pr-i	N(Me)	CH ₂	4-Me	CF ₃	H	

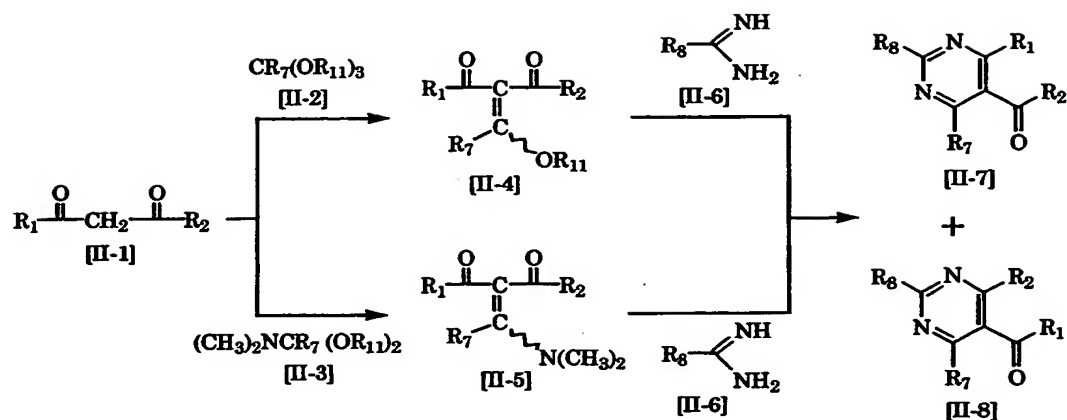
【0047】

本発明化合物は、例えば以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。尚、製造中間体の合成法も併せて記載する。

＜製造法1＞

【0048】

【化6】



【0049】

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_7 及び R_8 はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R_{11} はアルキル基を表す。)

即ち、一般式 [II-1] で表される化合物1モルに対し、一般式 [II-2] で表される化合物1～10倍モルを無水酢酸1～20倍モル中で反応させることにより、一般式 [II-4] で表される化合物を得ることができる。ここで、場合により触媒 (例えば塩化亜鉛等を例示できる。) 0.01～1.0モルを添加しても良い。

【0050】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0051】

又、一般式 [II-1] で表される化合物1モルに対し、一般式 [II-3] で表される化合物1～2倍モルを、無溶媒又は溶媒0.5～2l中で反応させることにより、一般式 [II-5] で表される化合物を得ることができる。

【0052】

ここで溶媒としては、例えばn-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0053】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0054】

次に、一般式 [II-4] で表される化合物1モルに対し、一般式 [II-6] で表される化合物のルイス酸塩1～1.5倍モルを、溶媒0.5～2l中、塩基1～2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式 [II-7] で表される化合物を得ることができる。本反応は、場合により一般式 [II-8] で表される化合物も副生成物として得られる。

【0055】

ここで溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0056】

塩基としては、例えばセトリウム、カリウム、ナトリウムメトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド、水素化ナトリウム及び水素化カリウム等を例示できる。

【0057】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0058】

更に、別法として一般式 [II-5] で表される化合物1モルに対し、一般式 [II-6] で表される化合物のルイス酸塩1～1.5倍モルを、溶媒0.5～2l中、塩基1～2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式 [II-7] で表される化合物を得ることができる。本反応は、場合により一般式 [II-8] で表される化合物も副生成物として得られる。

【0059】

溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0060】

塩基としては、例えばナトリウム、カリウム、ナトリウムメトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。

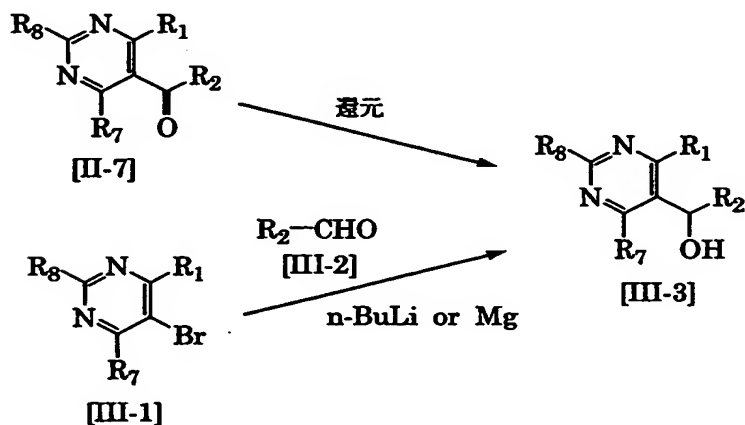
【0061】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法2>

【0062】

【化7】



【0063】

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_7 及び R_8 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、一般式 [II-7] で表される化合物1モルを、溶媒0.5~2l中、還元剤 (例えばボラン-*tert*-ブチルアミン錯体、水素化ホウ素ナトリウム等を例示できる。) 0.5~1モルで還元することにより、一般式 [III-3] で表される化合物を得ることができる。

【0064】

溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール及びメチルアルコール等のアルコール類を例示できる。

【0065】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0066】

又、別法として一般式 [III-1] で表される化合物1モルに対し、一般式 [III-2] で表される化合物1～2倍モルを、溶媒0.5～2l中、n-ブチルリチウム又はマグネシウム1～2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式 [III-3] で表される化合物を得ることができる。

【0067】

ここで溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、n-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0068】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -100°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

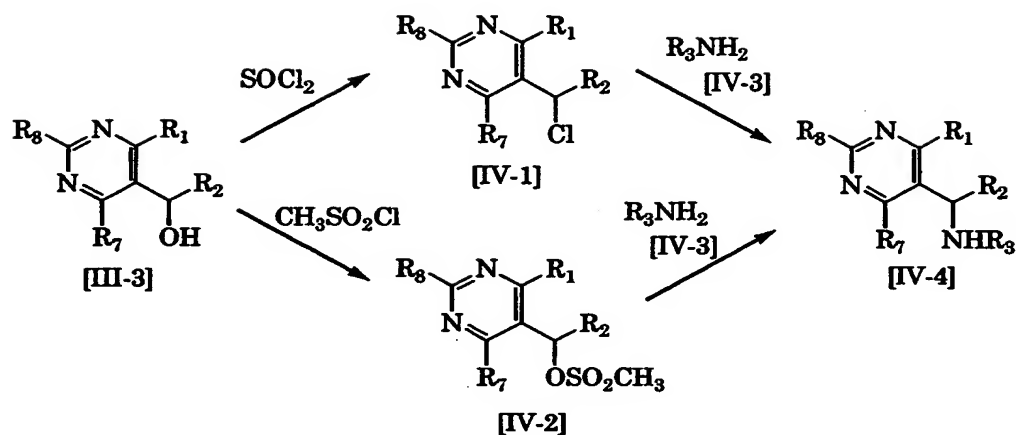
【0069】

なお、上記製造方法で用いる製造中間体である一般式 [III-1] で表される化合物は、例えば、国際出願W097/37978号公報明細書等に記載の方法で合成できる。

<製造法3>

【0070】

【化8】



【0071】

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 及び R_8 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、一般式 [III-3] で表される化合物1モルを、溶媒0.5~5l中、塩素化剤 (例えばチオニルクロリド及び塩化水素等を例示できる。) 1~10倍モルで塩素化することにより、一般式 [IV-1] で表される化合物を得ることができる。

【0072】

ここで溶媒としては、例えばクロロホルム及びジクロロメタン等のハロゲン化アルキル類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0073】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0074】

次に、一般式 [IV-1] で表される化合物1モルに対し、一般式 [IV-3] で表される化合物1~10倍モルを、溶媒0.5~5l中で反応させることにより、一般式 [IV-4] で表される化合物を得ることができる。

【0075】

ここで溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール及び

メチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類又は水を例示できる。

【0076】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は~~-10℃~~から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0077】

又、別法として一般式 [III-3] で表される化合物1モルと、メチルスルホニルクロリド1～2倍モルを、溶媒0.5～2l中、塩基1～10倍モルの存在下又は非存在下で反応させることにより、一般式 [IV-2] で表される化合物を得ることができ。

【0078】

ここで溶媒としては、例えばクロロホルム及びジクロロメタン等のハロゲン化アルキル類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類及びピリジンを例示できる。

【0079】

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、*tert*-ブトキシド等を例示できる。

【0080】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0081】

更に、一般式 [IV-2] で表される化合物1モルに対し、一般式 [IV-3] で表される化合物2～10倍モルを、溶媒0.5～2l中で反応させることにより、一般式 [IV-4] で表される化合物を得ることができる。

【0082】

ここで溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール及びメチルアルコールなどのアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン等のエーテル類、n-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類、ピリジン又は水を例示できる。

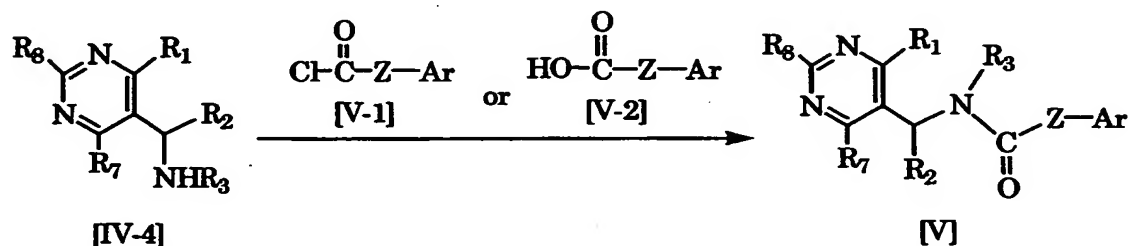
【0083】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法4>

【0084】

【化9】



【0085】

(式中、R₁、R₂、R₃、R₇、R₈、Z及びArはそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、一般式 [IV-4] で表される化合物1モルに対し、一般式 [V-1] で表される化合物1～2倍モルを、溶媒0.5～5l中、塩基1～2倍モルの存在下又は非存在下で反応させるか、又は、一般式 [IV-4] で表される化合物1モルに対し、一般式 [V-2] で表される化合物1～2倍モルを、溶媒0.5～5l中、縮合剤 (例えば1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドハイドロクロリドや1,1'

ーカルボニルビス-1H-イミダゾール等を例示できる。) 1~2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式 [V] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

【0086】

ここで溶媒としては、例えばクロロホルム及びジクロロメタン等のハロゲン化アルキル類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、n-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒を例示できる。

【0087】

塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム等の無機塩基類、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

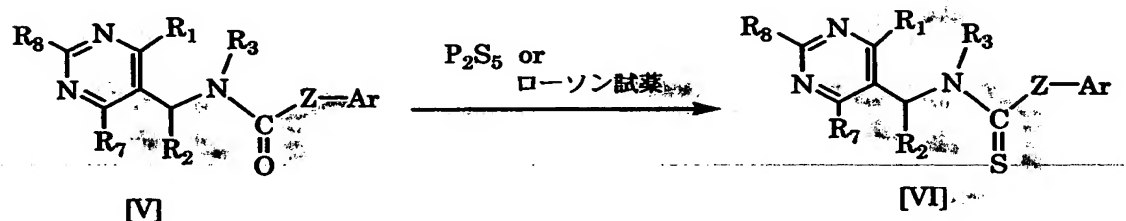
【0088】

何れの反応も場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法5>

【0089】

【化10】



【0090】

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 、Z及びArはそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、一般式 [V] で表される本発明化合物1モルを、溶媒0.5~5l中、五硫化

ニリン又はローソン試薬0.6~3倍モルと反応させることにより、一般式 [VI] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

【0091】

ここで溶媒としては、例えばn-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類又はピリジン等を例示できる。

【0092】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法6>

【0093】

【化11】



【0094】

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_7 、 R_8 及びArはそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、一般式 [IV-4] で表される化合物1モルに対し、一般式 [VII-1] で表される化合物0.9~3倍モルを、溶媒（製造法4の記載と同様である。）0.5~5l中で反応させることにより、一般式 [VII] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

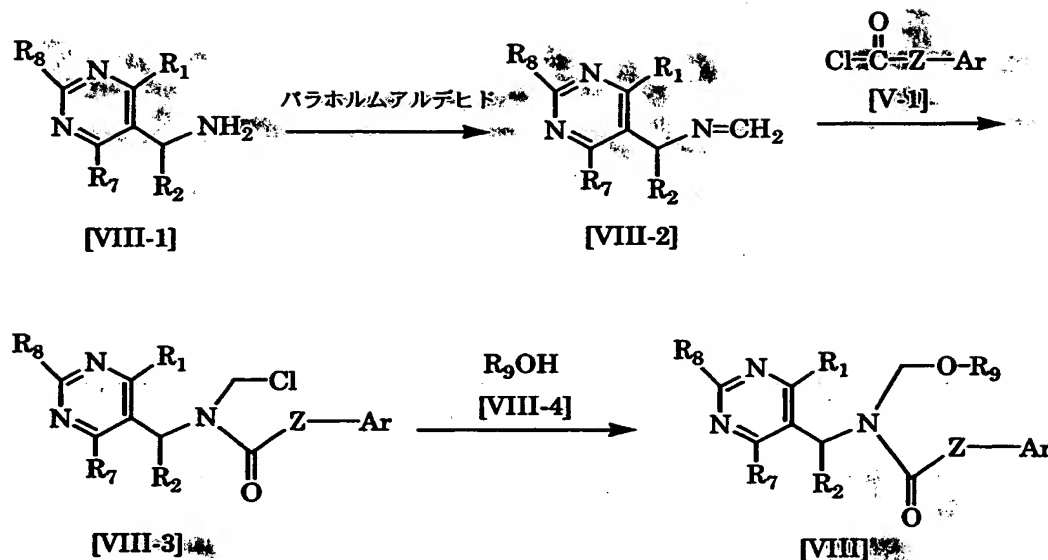
【0095】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法7>

【0096】

【化12】



【0097】

(式中、 R_1, R_2, R_7, R_8, Z 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R_9 はアルキル基を表わす。)

即ち、一般式 [VIII-1] で表される化合物を、溶媒中、パラホルムアルデヒド 1~3倍モルと反応させることにより（条件により、ディーンスタークの使用又は触媒を添加する）、一般式 [VIII-2] で表される化合物を得ることができる。

【0098】

ここで溶媒としては、例えばn-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0099】

触媒としては、例えばトリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

【0100】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又

はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0 1 0 1】

次に得られた一般式 [VIII-2] で表される化合物1モルを、溶媒1~10l中、[V-1] で表される化合物 1~1.5倍モルと反応させることにより、一般式 [VIII-3] で表される化合物を得ることができる。

【0 1 0 2】

ここで溶媒としては、例えばn-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0 1 0 3】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0 1 0 4】

更に得られた一般式 [VIII-3] で表される化合物1モルを、溶媒1~10l中、一般式 [VIII-4] で表される化合物 1~4倍モルと塩基の存在下で反応させることにより、一般式 [VIII] で表される本発明化合物を得ることができる。

【0 1 0 5】

ここで溶媒としては、例えばn-ヘキサン、ベンゼン及びトルエン等の炭化水素類を例示できる。

【0 1 0 6】

塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム等の無機塩基類、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

【0 1 0 7】

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

【0108】

【実施例】

次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化合物の合成中間体の製造法も併せて記載する。

【0109】

<製造例1>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルアセトアミド(本発明化合物番号1-8)の製造

4-トリフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリミジン6g(26ミリモル)及び炭酸カリウム3.6g(26ミリモル)をアセトニトリル150mlに溶解し、フェニルアセチルクロリド4g(26ミリモル)を滴下し、室温にて3時間攪拌した。反応溶液に水200mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗結晶をn-ヘキサンにて洗浄し、無色透明結晶(融点106~109℃)のN-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルアセトアミド7.7g(収率85%)を得た。

【0110】

<製造例2>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-2-ピリジルアセトアミド(本発明化合物番号2-3)の製造

2-ピリジニル酢酸塩酸塩0.3g(1.7ミリモル)及びトリエチルアミン0.18g(1.8ミリモル)をテトラヒドロフラン30mlに溶解し、1,1'-カルボニルビス-1H-イミダゾール0.28g(1.7ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。次に4-トリフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリミジン0.4g(1.7ミリモル)を加え、さらに3時間加熱還流した。反応溶液に水100mlを加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル:メタノール=4.5:4.5:1)で精製し、無色透明結晶(融点99~100℃)のN-メチル-N-[2-メチル-1-

— (4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル) プロピル]-2-ピリジルアセトアミド0.2g (収率33%) を得た。

【0111】

<製造例3>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル) プロピル] フェニルチオアセトアミド (本発明化合物番号1-142) の製造

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル) プロピル] フェニルアセトアミド0.45g(1.3ミリモル)及びローソン試薬0.52g(1.3ミリモル)をトルエン30mlに溶解し、30時間加熱還流した。反応溶液に水100mlを加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1) で精製し、淡黄色結晶 (融点93~94℃) のN-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル) プロピル] フェニルチオアセトアミド0.12g (収率26%) を得た。

【0112】

<製造例4>

N-メトキシメチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル) プロピル]-4-クロロフェニルアセトアミド (本発明化合物番号1-105) の製造

4-トリフルオロメチル-5-[1-アミノ-2-メチルプロピル]ピリミジン1.0g(4.6ミリモル)、パラホルムアルデヒド0.23g(6.9ミリモル)及びトリエチルアミン0.1g(9.9ミリモル)をトルエン50mlに溶解した。反応系からディーンスタークで脱水しながら1時間加熱還流した。反応溶液を室温に戻し4-クロロフェニルアセチルクロリド0.86g(4.6ミリモル)を滴下し、さらに2時間攪拌した。この溶液に、メタノール0.2g(6.2ミリモル)及びトリエチルアミン0.5g(4.9ミリモル)のトルエン溶液10mlを滴下し、室温で1時間攪拌した。反応溶液に水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロ

マトグラフィー（展開溶媒／*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）で精製し、無色透明結晶（融点142～145℃）のN-メトキシメチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-4-クロロフェニルアセトアミド0.5g（収率26%）を得た。

【0113】

<製造例5>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-N'-(4-メチルフェニル)ウレア（本発明化合物番号1-37）の製造

4-クロロジフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリミジン0.50g(2.1ミリモル)及び4-メチルフェニルイソシアナート0.28g(2.1ミリモル)をイツプロピルエーテル30mlに溶解し、室温にて1時間攪拌した。析出した結晶を別し、無色透明結晶（融点135～137℃）のN-メチル-N-[2-メチル-1-(4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-N'-(4-メチルフェニル)ウレア0.65g（収率84%）を得た。

【0114】

（中間体の製造例）

<参考例1>

3-エトキシメチレン-1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオン（化合物II-4）の製造

1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオン213g(1.17モル)、オルトギ酸エチル242g(1.64モル)及び無水酢酸166g(1.63モル)の混合物を6時間加熱還流した。溶媒を減圧下留去じ、3-エトキシメチレン-1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオン146g（収率67%）を得た。

【0115】

<参考例2>

5-イソプロピルカルボニル-4-トリフルオロメチルピリミジン（化合物II-7）の製造

ナトリウムメトキシド46g(0.85モル)をメタノール700mlに溶解し、ホルムアミ

ジン酢酸塩76g(0.73モル)を加え室温で15分攪拌した。次に3-エトキシメチレン-1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサジオン146g(0.61モル)を氷冷下に加え、さらに2時間加熱還流した。溶媒を減圧下留去し、氷水1000mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒/*n*-ヘキサン:酢酸エチル=6:1）で精製し、淡黄色液体の5-イソプロピルカルボニル-4-トリフルオロメチルピリミジン89g（収率67%）を得た。

【0116】

＜参考例3＞

5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-トリフルオロメチルピリミジン（化合物III-3）の製造

5-イソプロピルカルボニル-4-トリフルオロメチルピリミジン25g（115ミリモル）をエタノール100mlに溶解し、氷冷下、ボラン-*tert*-ブチルアミン錯体6g（69ミリモル）を加え2時間攪拌した。さらにアセトン20mlを加え、0.5時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒/*n*-ヘキサン:酢酸エチル=1:1）で精製し、淡黄色液体（屈折率 n_D^{20} :1.4481）の5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-トリフルオロメチルピリミジン22g（収率86.9%）を得た。

【0117】

＜参考例4＞

5-（1-クロル-2-メチルプロピル）-4-トリフルオロメチルピリミジン（化合物IV-1）の製造

5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-トリフルオロメチルピリミジン22g（100ミリモル）をクロロホルム150mlに溶解し、チオニルクロリド25ml（342ミリモル）を加えた。反応混合物を2時間加熱還流した。溶媒及びチオニルクロリドを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒/*n*-ヘキサン:酢酸エチル=6:1）で精製し、褐色液体（屈折率 n_D^{20} :1.4558）の5-（1-クロル-2-メチルプロピル）-4-トリフルオロメチルピリミジン11.6g（

収率48.6%)を得た。

【0118】

<参考例5>

5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-トリフルオロメチルピリミジン (化合物IV-4) の製造

5-(1-クロロ-2-メチルプロピル)-4-トリフルオロメチルピリミジン4.5g(19ミリモル)をイソプロピルアルコール50mlに溶解し、50%メチルアミン水溶液10ml(161ミリモル)を加え、室温にて8時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、淡黄色液体(屈折率 n_D^{20} :1.4529)の5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-トリフルオロメチルピリミジン3.4g(収率77%)を得た。

【0119】

<参考例6>

4-エトキシメチレン-2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン (化合物II-4) の製造

2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン17.2g(110ミリモル)、オルトギ酸エチル22.8g(153ミリモル)及び無水酢酸31.5g(309ミリモル)の混合物を2時間110℃で反応させた。溶媒を減圧下留去し、4-エトキシメチレン-2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン11.5g(収率49%)を得た。

【0120】

<参考例7>

5-イソプロピルカルボニル-4-イソプロピルピリミジン (化合物II-7) の製造

28%ナトリウムメトキシド溶液11.5g(60ミリモル)をメタノール100mlに溶解し、ホルムアミジン酢酸塩5.6g(54ミリモル)を加え、室温で15分攪拌した。次に4-エトキシメチレン-2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン11.5g(54ミリモル)を氷冷下に加えた。反応混合物をさらに50℃にて1時間反応させた。溶媒を減圧下留去し、水200mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄し

た後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒／*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で精製し、淡黄色液体の5-イソプロピルカルボニル-4-イソプロピルピリミジン9.2g（収率89%）を得た。

【0121】

<参考例8>

5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-イソプロピルピリミジン（化合物III-3）の製造

5-イソプロピルカルボニル-4-イソプロピルピリミジン9.2g（48ミリモル）をエタノール50mlに溶解し、氷冷下、ボラン-*tert*-ブチルアミン錯体2.5g（29ミリモル）を加え2時間攪拌した。さらにアセトン20mlを加え0.5時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、水200mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-イソプロピルピリミジン8.3g（収率89%）の目的物を得た。

【0122】

<参考例9>

5-（1-メチルスルホニルオキシ-2-メチルプロピル）-4-イソプロピルピリミジン（化合物IV-2）の製造

5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-イソプロピルピリミジン8.3g（43ミリモル）をピリジン10mlに溶解し、氷冷下、メチルスルホニルクロリド9.8g（86ミリモル）を滴下した。反応混合物を室温にて2時間反応させた後、氷水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層をクエン酸水溶液、水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、5-（1-メチルスルホニルオキシ-2-メチルプロピル）-4-イソプロピルピリミジン10.6g（収率90%）を得た。

【0123】

<参考例10>

5-[1-(*N*-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-イソプロピルピリミジ

ン（化合物IV-4）の製造

5-（1-メチルスルホニルオキシ-2-メチルプロピル）-4-イソプロピルピリミジン10.6g(39ミリモル)をイソプロピルアルコール50mlに溶解し、40%メチルアミン水溶液10ml(129ミリモル)を加え、室温にて8時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧下留去し、水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒=酢酸エチル）で精製し、淡黄色結晶（融点37~39℃）の5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-イソプロピルピリミジン2.9g（収率36%）を得た。

【0124】

<参考例11>

5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-メチルチオピリミジン（化合物III-3）の製造

5-ブロモ-4-メチルチオピリミジン10.6g(52ミリモル)をテトラヒドロフラン100mlに溶解し、-60℃にてn-ブチルリチウムヘキサン溶液（1.6mol/l）36mlを滴下した。-60℃で30分攪拌した後、イソブチルアルデヒド4.1g(57ミリモル)を滴下し、さらに1時間反応させた。反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒/n-ヘキサン：酢酸エチル=3：2）で精製し、淡黄色結晶（融点123~127℃）の5-（1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-メチルチオピリミジン2.9g（収率28%）を得た。

【0125】

本発明の除草剤は、一般式 [I] で示されるピリミジン誘導体を有効成分としてなる。

【0126】

本発明化合物を除草剤として使用するには本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤または補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、微粒剤または粒剤等に製剤して使用することも

できる。

【0 1 2 7】

製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。

【0 1 2 8】

界面活性剤及び分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するかまたは直接施用する。

【0 1 2 9】

本発明の除草剤は茎葉散布、土壌施用または水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤または粒剤とする場合は 0.01～10%（重量）、好ましくは 0.05～5%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤とする場合は 1～50%（重量）、好ましくは 5～30%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。

【0 1 3 0】

本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤及び粒剤のようにそのまま使用の場合は、有効成分として 10 アール当り 0.1 g～5 kg、好ましくは 1 g～1 kg の範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤とする場合のように液状で使用する場合は、0.1～50,000 ppm、好ましくは 10～10,000 ppm の範囲から適宜選ぶのがよい。

【0 1 3 1】

また、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長

調節剤、肥料等と混用してもよい。

【0132】

次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

【0133】

〈製剤例1〉 水和剤

化合物(1-8)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 β -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、クレーの69部を混合粉碎し、水和剤を得る。

【0134】

〈製剤例2〉 水和剤

化合物(1-8)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 β -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイトカーボンの5部、クレーの64部を混合粉碎し、水和剤を得る。

【0135】

〈製剤例3〉 水和剤

化合物(1-8)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 β -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイトカーボンの5部、炭酸カルシウムの64部を混合粉碎し、水和剤を得る。

【0136】

〈製剤例4〉 乳剤

化合物(1-8)の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリアルポリマー及びアルキルアリアルスルホネートの混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得る。

【0137】

〈製剤例 5〉 粒剤

化合物（1-8）の 10 部、タルクとベントナイトを 1：3 の割合で混合した増量剤の 80 部、ホワイトカーボンの 5 部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリアルポリマー及びアルキルアリアルスルホネートの混合物の 5 部に水 10 部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径 0.7 mm のふるい穴から押し出して乾燥した後に 0.5～1 mm の長さに切断し、粒剤を得る。

【0138】

次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

〈試験例 1〉 水田土壌処理による除草効果試験

100 cm² プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌピエ（Ec）、コナギ（Mo）の種子を播種し、水深 3 cm に湛水した。翌日、製剤例 1 に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を 10 アール当り 100 g とした。その後、温室内で育成し、処理後 21 日目に表 20 の基準に従って除草効果を調査した。結果を表 21 に示す。

【0139】

【表 20】

指数	除草効果(生育抑制程度)及び葉害
5	90%以上の抑制の除草効果、葉害
4	70%以上90%未満の除草効果、葉害
3	50%以上70%未満の除草効果、葉害
2	30%以上50%未満の除草効果、葉害
1	10%以上30%未満の除草効果、葉害
0	0%以上10%未満の除草効果、葉害

【0140】

【表 21】

化合物 番 号	薬 量 ai.g/10a	除 草 効 果 Ec Mo	化合物 番 号	薬 量 ai.g/10a	除 草 効 果 Ec Mo
1-8	100	5 5	1-75	100	5 5
1-9	100	5 5	1-76	100	5 5
1-10	100	5 5	1-78	100	5 5
1-12	100	5 5	1-80	100	5 5
1-13	100	5 5	1-81	100	5 5
1-15	100	5 5	1-82	100	5 5
1-16	100	5 5	1-83	100	5 5
1-17	100	5 5	1-84	100	5 5
1-18	100	5 5	1-85	100	5 5
1-19	100	5 5	1-86	100	5 5
1-20	100	5 5	1-87	100	5 5
1-21	100	5 5	1-88	100	5 5
1-22	100	5 5	1-89	100	5 5
1-23	100	5 5	1-90	100	5 5
1-24	100	5 5	1-91	100	5 5
1-25	100	5 5	1-92	100	4 5
1-26	100	5 5	1-93	100	5 5
1-27	100	5 5	1-94	100	5 5
1-32	100	5 5	1-95	100	5 5
1-33	100	5 5	1-96	100	5 5
1-34	100	5 5	1-97	100	5 5
1-35	100	5 5	1-98	100	5 5
1-36	100	5 5	1-99	100	5 5
1-37	100	5 5	1-100	100	5 5
1-38	100	5 5	1-101	100	5 5
1-39	100	5 5	1-102	100	5 5
1-40	100	5 5	1-103	100	5 5
1-41	100	5 5	1-104	100	5 5
1-42	100	5 5	1-105	100	5 5
1-44	100	5 5	1-106	100	5 5
1-45	100	5 5	1-107	100	5 5
1-46	100	5 5	1-111	100	5 4
1-47	100	5 5	1-112	100	5 5
1-48	100	5 5	1-113	100	5 5
1-49	100	5 5	1-114	100	5 5
1-50	100	5 5	1-115	100	5 5
1-51	100	5 5	1-122	100	5 5
1-52	100	5 5	1-126	100	5 5
1-53	100	5 5	1-127	100	5 5
1-54	100	5 5	1-128	100	5 4
1-55	100	5 5	1-129	100	5 5
1-56	100	5 5	1-136	100	5 5
1-57	100	5 5	1-138	100	5 5
1-58	100	5 5	1-142	100	5 5
1-59	100	5 5	1-144	100	5 5
1-60	100	5 5	1-147	100	5 5
1-61	100	5 5	1-148	100	5 5
1-62	100	5 5	1-151	100	5 5
1-63	100	5 5	1-152	100	5 5
1-64	100	5 5	1-161	100	5 5
1-65	100	5 5	1-162	100	5 5
1-66	100	5 5	1-165	100	5 5
1-68	100	5 5	1-166	100	5 5
1-70	100	5 5	2-2	100	5 5
1-71	100	5 5	2-3	100	5 5
1-72	100	5 5	2-6	100	5 5
1-74	100	5 5			

【0141】

〈試験例2〉 畑地土壌処理による除草効果試験

80cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ（Ec）、エノコログサ（Se）の種子を播種して覆土した。製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、10アール当り有効成分が100gになる様に、10アール当り1001を小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表20の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表22に示す。

【0142】

【表22】

化合物 番 号	薬 量 aig/10a	除 草 効 果 Ec	Se	化合物 番 号	薬 量 aig/10a	除 草 効 果 Ec	Se
1-8	100	5	5	1-95	100	5	5
1-9	100	5	5	1-96	100	5	5
1-10	100	4	4	1-97	100	5	5
1-12	100	5	5	1-98	100	5	5
1-13	100	5	5	1-99	100	5	5
1-15	100	5	5	1-100	100	5	5
1-16	100	4	5	1-101	100	5	5
1-17	100	4	4	1-102	100	5	5
1-20	100	5	5	1-103	100	5	5
1-21	100	5	5	1-105	100	5	5
1-22	100	5	5	1-106	100	5	4
1-23	100	5	5	1-111	100	5	5
1-24	100	5	5	1-112	100	5	5
1-25	100	5	5	1-113	100	5	4
1-26	100	5	5	1-114	100	5	5
1-27	100	5	5	1-115	100	5	5
1-32	100	5	5	1-116	100	5	4
1-33	100	5	5	1-118	100	5	5
1-34	100	5	5	1-119	100	5	4
1-35	100	5	5	1-120	100	5	4
1-36	100	5	5	1-121	100	5	4
1-37	100	5	5	1-122	100	5	5
1-38	100	5	4	1-123	100	5	5
1-40	100	5	4	1-124	100	5	5
1-41	100	5	5	1-125	100	5	5
1-42	100	5	5	1-126	100	5	5
1-45	100	5	5	1-127	100	5	5
1-46	100	5	5	1-128	100	5	5
1-47	100	5	5	1-130	100	5	5
1-48	100	5	5	1-131	100	5	5
1-49	100	5	4	1-133	100	5	5
1-50	100	5	5	1-134	100	5	5
1-51	100	5	5	1-135	100	5	5
1-52	100	5	5	1-136	100	5	5
1-53	100	5	5	1-137	100	5	5
1-54	100	5	5	1-138	100	5	5
1-55	100	5	5	1-139	100	5	5
1-56	100	5	5	1-141	100	5	5
1-57	100	5	5	1-142	100	5	5
1-58	100	5	5	1-143	100	5	5
1-59	100	5	5	1-144	100	5	5
1-60	100	5	5	1-145	100	5	5
1-61	100	5	5	1-146	100	4	4
1-62	100	4	4	1-147	100	5	5
1-63	100	5	5	1-148	100	5	5
1-64	100	5	5	1-150	100	5	5
1-65	100	5	5	1-151	100	5	5
1-66	100	5	5	1-153	100	5	5
1-67	100	5	5	1-155	100	4	4
1-68	100	5	5	1-159	100	5	5
1-70	100	5	5	1-160	100	5	5
1-71	100	5	5	1-161	100	5	5
1-72	100	5	4	1-162	100	5	4
1-74	100	5	5	1-163	100	5	5
1-75	100	5	5	1-164	100	5	5
1-76	100	5	5	1-165	100	5	5
1-77	100	5	5	1-166	100	5	5
1-78	100	5	5	1-167	100	5	5
1-80	100	5	5	1-168	100	5	5
1-81	100	5	5	1-169	100	5	5
1-83	100	5	5	1-170	100	5	5
1-85	100	5	5	1-171	100	5	4
1-87	100	5	5	1-177	100	4	4
1-88	100	5	5	1-180	100	5	5
1-89	100	5	5	2-1	100	5	4
1-90	100	5	5	2-2	100	5	4
1-91	100	4	5	2-6	100	5	4
1-92	100	5	5				

【0143】

＜試験例3＞ 畑地茎葉処理による除草効果試験

80cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ（Ec）、エノコログサ（Se）の種子を播種し、温室内で2週間育成後、製剤例1に準じて調製した水和剤を水に希釈し、10アール当り有効成分が100gになる様に、10アール当り100lを小型噴霧器で植物体の上方から全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成し、処理14日目に表20の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表23に示す。

【0144】

【表23】

化合物 番 号	薬 量 ai.g/10a	除 草 効 果		化合物 番 号	薬 量 ai.g/10a	除 草 効 果	
		Ec	Se			Ec	Se
1-8	100	5	4	1-66	100	5	4
1-9	100	5	4	1-78	100	5	4
1-10	100	4	4	1-81	100	4	4
1-12	100	5	4	1-83	100	5	4
1-13	100	5	4	1-87	100	4	4
1-21	100	4	4	1-88	100	4	4
1-22	100	4	4	1-89	100	5	4
1-24	100	4	4	1-92	100	5	4
1-26	100	4	4	1-98	100	4	4
1-27	100	4	4	1-100	100	5	5
1-41	100	5	4	1-107	100	4	4
1-42	100	4	4	1-111	100	4	4
1-46	100	4	4	1-112	100	4	5
1-47	100	4	4	1-113	100	4	4
1-48	100	5	4	1-122	100	4	4
1-50	100	4	4	1-127	100	4	4
1-53	100	4	4	1-129	100	5	5
1-54	100	5	4	1-133	100	5	4
1-55	100	4	4	1-137	100	5	4
1-56	100	4	4	1-142	100	4	4
1-57	100	5	4	1-143	100	4	4
1-58	100	4	4	1-144	100	4	4
1-59	100	4	4	1-152	100	4	4
1-60	100	4	4	1-153	100	4	4
1-61	100	4	4	1-164	100	4	4

【0145】

【発明の効果】

一般式〔I〕で表される本発明の化合物は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイヌタデ、アオビユ、シロザ、ハコベ、イチビ、アメリカキンゴジカ、アメリカツノクサネム、アサガオ、オナモミ等の広葉雑草をはじめ、ハマ

スゲ、キハマスゲ、ヒメクグ、カヤツリグサ、コゴメガヤツリ等の多年生および1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ、メヒシバ、エノコログサ、スズメノカタビラ、ジョンソングラス、ノスズメノテッポウ、野生エンバク等のイネ科雑草の発芽前から生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発揮する。また、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ等の一年生雑草及びウリカワ、オモダカ、ミズガヤツリ、クログワイ、ホタルイ、ヘラオモダカ等の多年生雑草を防除することもできる。

【0146】

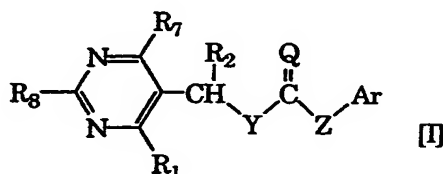
一方、本発明の除草剤は作物に対する安全性も高く、中でもイネ、コムギ、オムギ、トウモロコシ、グレインソルガム、ダイズ、ワタ、テンサイ等に対して高い安全性を示す。

【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 有用作物に対して、優れた除草活性ならびに作物雑草間に選択性を有するピリミジン誘導体を提供する。

【解決手段】 一般式 [I]



(式中、 R_1 は水素原子、ハロゲン原子又はハロアルキル基等を表し、 Y は NR_3 を表し、 R_3 は水素原子、アルキル基又はアルケニル基等を表し、 Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、 Z は酸素原子、硫黄原子又は基 $-C(R_4)R_5-$ 等を表し、 R_4 及び R_5 は水素原子、アルキル基又はアルコキシ基等を表し、 Ar 基はフェニル基又はピリジル基等を表し、 R_7 は水素原子、アルキル基又はハロアルキル基等を表し、 R_8 は水素原子、アルキル基又はアルキルチオ基等を表す。) にて表されるピリミジン誘導体及び該ピリミジン誘導体を有効成分として含有する農薬、特に除草剤。

【選択図】 なし

認定・付加情報

特許出願の番号 平成11年 特許願 第255029号
受付番号 59900876462
書類名 特許願
担当官 小菅 博 2.143.
作成日 平成11年11月29日

<認定情報・付加情報>

【特許出願人】 申請人
【識別番号】 000000169
【住所又は居所】 東京都台東区池之端1丁目4番26号
【氏名又は名称】 クミアイ化学工業株式会社
【特許出願人】
【識別番号】 000102049
【住所又は居所】 東京都台東区池之端1丁目4番26号
【氏名又は名称】 イカサカミカル工業株式会社

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000000169]

1. 変更年月日 1990年 8月29日
[変更理由] 新規登録
住 所 東京都台東区池之端1丁目4番26号
氏 名 クミアイ化学工業株式会社

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[0000102049]

1. 変更年月日 1990年 8月28日

[変更理由] 新規登録

住 所 東京都台東区池之端1丁目4番26号

氏 名 イハラケミカル工業株式会社